

⑨ 日本国特許庁 (JP) ⑩ 特許出願公開  
 ⑪ 公開特許公報 (A) 昭55-124763

⑫ Int. Cl.<sup>3</sup>  
 C 07 D 213/64  
 213/70

識別記号 庁内整理番号  
 7138-4C  
 7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日  
 発明の数 1  
 審査請求 未請求

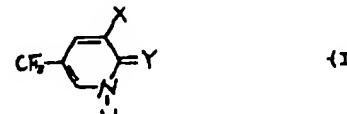
(全3頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体  
 ⑮ 特願 昭54-32068  
 ⑯ 出願 昭54(1979)3月19日  
 ⑰ 発明者 西山隆三  
 高槻市真上町5丁目41番22号  
 ⑱ 発明者 藤川致一  
 守山市浮気町321番地の31  
 ⑲ 発明者 横道歎  
 草津市野村町221番地

⑲ 発明者 芳賀隆弘  
 草津市野村町221番地  
 ⑳ 発明者 長谷邦昭  
 守山市浮気町321番地の31  
 ㉑ 発明者 林弘仁  
 守山市浮気町321番地の31  
 ㉒ 出願人 石原産業株式会社  
 大阪市西区江戸堀1丁目3番11  
 号

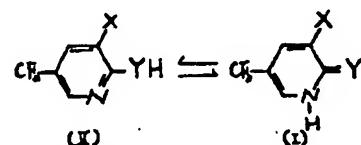
明細書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体



(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。

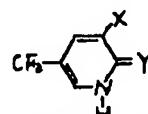


(式中X及びYは前述の通りである)

前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としてはヨウ素、溴素、臭素、砹素が挙げられる。

2. 特許請求の範囲

1. 一般式



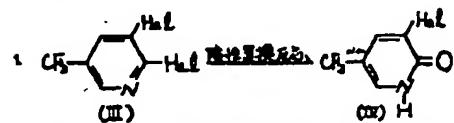
(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中间原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

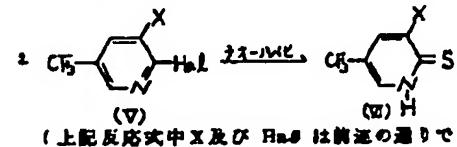
詳しくは本発明は一般式

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ヒドロ-5-シクロヘキサ-2,4-ジエン基は通常、例えば下記方法によって製造される。



(上記反応式中  $\text{HgS}$  はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのフルカリ水溶液を用いて50～150℃、0.1～10時間で行なわれる。



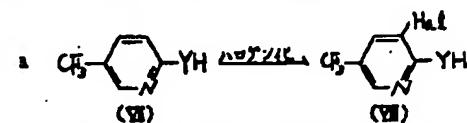
ある)

一般に上記反応はノタノール、エタノールなどのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの弱プロトン性溶

- 3 -

新嘉坡 55-124763(2)

鐵などの無機中、チオ尿素、溴化ソーダ、チオ硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50~100度で行なわれる。

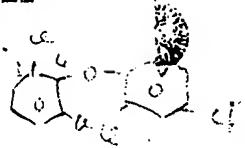


( 上記反応式中 Y 及び H<sub>2</sub>S は前述の通りである )

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒などの溶媒中、窒素ガス、臭素、チオニルクロライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン化剤を用いて0～100℃、0.5～10時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハログン化ニトロペ  
ンゼン類と結合させて4-(5-トリフルオロ  
メチルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベン  
ゼン類を生成させ、これを還元して得られる4  
-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イ  
ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアニ

- 4 -



死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例 1 3-クロロ-5-トキフルオロメチル-2-ピリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ヒドロン<sub>2</sub>をクロロホルム20mlに溶解させ、50℃に加熱して塩素ガスを1時間攪拌下に通じた。反応終了後、クロロホルムを留安し、トルエン-クロ-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点144~147℃の目的物0.15gを得た。

〔 B 〕

水酸化ナトリウム 2.4 g を水 12.5 ml に溶  
解させた水溶液に 2,3-ジクロロ-5-トリ  
フルオロノメチルヒリジン 4 g を加え、更にジ  
メチルスルホキシド 12.5 ml を加えて加熱し、  
110°C で 1 時間攪拌下に反応させた。反応  
終了後生成物を放冷し、最極端で酸性にして  
沈殿物を得、このものを滤過して目的物 2.5

ト類とを反応させることによりN-ベンゾイ  
ル-N'-(4-(5-トリフルオロメチルビリ  
ジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレア系化  
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3  
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ  
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを  
総合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク  
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-  
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2  
,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを  
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾ  
イル)-N-(3,5-ジクロロ-4-(3-ク  
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-  
イルオキシ)フェニル)ウレアを得ることがで  
きる。このものは農虫類の有効成分として優れ  
た活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆蟲の  
防除に有効であって、例えばこの化合物<sup>2</sup> 100  
ppm水分散液にキバウツの葉片を浸漬し、それ  
を風乾してそこへ2~3合のコナガの幼虫を散  
らし、8日目に生死を判定した結果、100%の

- 8 -

- 6 -

を得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-テオ  
ビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルヒリジン 4 g とテオ酸 16.7 g をエタノール 30 ml に溶解させ、加熱して還流状態で 3 時間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリウム水溶液 1.23 g を徐々に加えて還流状態で 1 時間反応させた。反応終了後、生成物を放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次いで、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレンを除去して融点 147~150 °C の目的物 2.1 g を得た。

合成例 3 3-プロセ-5-トリフルオロメチル-2-ビリドン

5-トリフルオロメチル-2-ヒリドン 0.4 g を酢酸 10 ml に溶解させ、そこへ臭素 0.4 g を加えて攪拌下で 4 時間反応させた。反

特許昭55-124763(3)

応終了後、酢酸を除去し、塩化メチレン-ローハキサンの混合溶媒で再結晶して融点 162~165 °C の目的物 0.45 g を得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-テオビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルヒリジン 4 g に代えて 2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルヒリジン 4.75 g を用いる以外は前記合成例 2 と同様にして反応を行ない、後処理を行なって融点 125~128 °C の目的物 1.9 g を得た。

特許出願人 石原産業株式会社